

АЦИЛИРОВАНИЕ БЕНЗАЛЬАЦЕТОНОВ В УСЛОВИЯХ КИСЛОТНОГО КАТАЛИЗА

Чудинов А.В., Соловьева Я.В., Томилов В.Л., Усачев С.А., Сосновских В.Я.

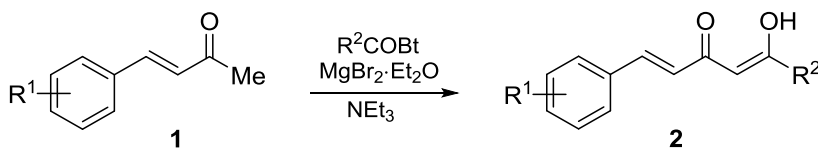
Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Ряд природных соединений, используемых в медицине, содержит фрагмент α,β -ненасыщенных β -дикетонов, например сифонариндион и циклоэпиаталантин. Эта комбинация функциональных групп также имеет синтетическое применение для получения 4-пиронов, 3-галоген-4-пиронов, пиразолов, 1-гидрокси-4-пиридонов и многих других гетероциклов и их ансамблей.

Ацилирование кетонов с образованием β -дикетонов является важной реакцией образования углерод-углеродной связи. Среди большого числа методик, дающих β -дикарбонильные соединения, 2,3-ненасыщенные производные получают при ацилировании α,β -ненасыщенными ацилхлоридами в присутствии амида натрия, пиридина, триэтиламина или ЛДА; α,β -ненасыщенными эфирами в присутствии $\text{Si}(\text{OMe})_4/\text{CsF}$, этилата натрия или *n*-бутиллития; альдольной реакции сопряженных альдегидов с последующим окислением промежуточных спиртов. Ещё один метод включает реакцию кетонов с 2,2-диэтоксивинилидентрифенилфосфораном с образованием стабильного илида, который затем конденсируют с бензальдегидом и обрабатывают кислотой.

Наиболее удобным на наш взгляд с синтетической точки зрения и позволяющим легко получать библиотеки соединений, является подход, основанный на ацилировании метилвинилкетонов. Он представлен в литературе только единичными примерами, из которых наиболее привлекательный включает использование ацилбензотриазола с бензальацетоном в присутствии эфирата дибромиды магния.

Нами был расширен ряд субстратов, входящих в эту реакцию, и показана ее пригодность для ароматических, гетероароматических и алифатических производных.



$\text{R}^1 = \text{H}, 4\text{-Cl}, 4\text{-Me}, 4\text{-MeO}, 4\text{-NO}_2, 2,4\text{-diCl};$

$\text{R}^2 = \text{Ph}, 2\text{-furyl}, \text{Me}$

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант № 17-03-00340).